

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
27. Juni 2002 (27.06.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 02/50077 A2**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **C07D 487/04**,  
A01N 43/90, C07C 211/24

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/14415

(22) Internationales Anmeldedatum:  
7. Dezember 2001 (07.12.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
100 63 115.0 18. Dezember 2000 (18.12.2000) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE];  
51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **GEBAUER, Olaf**  
[DE/DE]; Jesuitengasse 111, 50737 Köln (DE). **ELBE,**  
**Hans-Ludwig** [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wup-  
pertal (DE). **HENRICH, Marielouise** [DE/DE]; Hey-  
mannstr. 38, 51373 Leverkusen (DE). **MARHOLD,**  
**Albrecht** [DE/DE]; Carl-Duisberg-Str. 329, 51373 Lev-  
erkusen (DE). **WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike**  
[DE/DE]; Oberer Markweg 85, 56566 Neuwied (DE).  
**MAULER-MACHNIK, Astrid** [DE/DE]; Neuenkamper  
Weg 48, 42799 Leichlingen (DE). **KUCK, Karl-Heinz**  
[DE/DE]; Pastor-Loeh-Str. 30a, 40764 Langenfeld (DE).  
**VOERSTE, Arnd** [DE/DE]; Sahlierring 33, 50677  
Köln (DE). **KITAGAWA, Yoshinori** [JP/JP]; P.O. Box

157, Tokyo, Tokyo 103-91 (JP). **HEINEMANN, Ulrich**  
[DE/DE]; Am Sonnenhang 1, 42799 Leichlingen (DE).  
**HILGERS, Petra** [DE/DE]; Sandweg 10, 51503 Rösrath  
(DE). **PLESCHKE, Axel** [DE/DE]; Im Thurner Feld 41,  
51069 Köln (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER AKTIENGE-  
SELLSCHAFT**; 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,  
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,  
SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US,  
UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,  
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),  
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,  
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu  
veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen  
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on  
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe  
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: **TRIAZOLOPYRIMIDINES**

(54) Bezeichnung: **TRIAZOLOPYRIMIDINE**

(57) Abstract: The invention relates to novel triazolopyrimidines of formula (I) in which R1, R2, R3 and X have the meaning given in the description, a method for the production of said novel materials and the use thereof for combating undesired micro-organisms and animal pests. The invention further relates to novel amines of formula (IIIa) in which R4 has the meanings given in the description and method for production thereof.

(57) Zusammenfassung: Neue Triazolopyrimidine der Formel (I) in welcher R1, R2, R3 und X die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, ein Verfahren zur Herstellung dieser neuen Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen und tierischen Schädlingen. Neue Amine der Formel (IIIa) in welcher R4 die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen hat, sowie Verfahren zu deren Herstellung.



**WO 02/50077 A2**

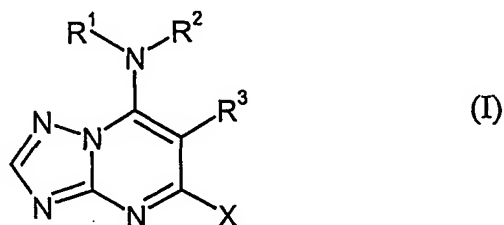
### Triazolopyrimidine

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Triazolopyrimidine, ein Verfahren zu ihrer  
5 Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikro-  
organismen und tierischen Schädlingen.

Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte Triazolopyrimidine fungizide  
Eigenschaften besitzen (vgl. EP-A 0 550 113, WO 94-20 501, EP-A 0 613 900, US  
10 5 612 345, EP-A 0 834 513, WO 98-46 607 und WO 98-46 608). Die Wirksamkeit  
dieser Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu  
wünschen übrig.

Es wurden nun neue Triazolopyrimidine der Formel

15



in welcher

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> unabhängig voneinander für Alkyl stehen, das einfach oder mehrfach,  
20 gleichartig oder verschieden substituiert ist durch Halogen, Cyano, Nitro,  
Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Alkoxy,  
Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Halogen-  
alkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl, Halogenalkylsulfonyl,  
Halogenalkenyloxy, Halogenalkenylthio, Halogenalkenylsulfinyl, Halogen-  
25 alkenylsulfonyl, Halogenalkinyloxy, Halogenalkinylthio, Halogenalkinyl-  
sulfinyl, Halogenalkinylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl,  
Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Di-

alkylaminothiocarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Hydroximinoalkyl, Alkoximinoalkyl, Cycloalkyl, Aryl und/oder Heterocyclyl, oder

5 für gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl stehen,

R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht oder für substituiertes Aryl steht, wobei aber mindestens ein Substituent aus der folgenden Gruppe von Resten vorhanden ist

10 Formyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl, Halogenalkylsulfonyl, Halogenalkenyl, Halogenalkinyl, Halogenalkenyloxy, Halogenalkinyloxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl, zweifach verknüpftes Alkylen mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, das einfach  
15 oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,

20 zweifach verknüpftes Oxyalkylen mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, das einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,

25 zweifach verknüpftes Dioxyalkylen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, wobei die Sauerstoffatome jedoch nicht benachbart stehen und wobei die Alkylenkette einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,

30

und

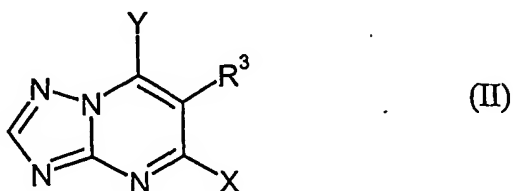
- 3 -

X für Halogen steht,

gefunden.

5

Weiterhin wurde gefunden, dass sich Triazolopyrimidine der Formel (I) herstellen lassen, indem man Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel



10

in welcher

R<sup>3</sup> und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

15

Y für Halogen steht,

mit Aminen der Formel



20

in welcher

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umgesetzt.

Schließlich wurde gefunden, dass sich die neuen Triazolopyrimidine der Formel (I) sehr gut zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen und tierischen Schädlingen eignen. Sie zeigen vor allem eine starke fungizide und insektizide Wirkung.

5

Überraschenderweise besitzen die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine der Formel (I) eine wesentlich bessere fungizide und insektizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichsten, vorbekannten Stoffe gleicher Wirkungsrichtung.

10 Die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugt sind diejenigen Stoffe der Formel (I), in denen

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> unabhängig voneinander für Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen stehen, wobei die Alkylreste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Alkoxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkylsulfinyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkylsulfonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkylthio mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkylsulfinyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkylsulfonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkenyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkenylthio mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkenylsulfinyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkenylsulfonyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkinyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkinylthio mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkinylsulfinyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkinylsulfonyl mit 2 bis 6 Kohlen-

stoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Alkylamino mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Dialkylamino mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in jedem Alkylteil, Alkylcarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Alkylaminocarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Dialkylaminocarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in jedem Alkylteil, Alkylaminothiocarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Dialkylaminothiocarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in jedem Alkylteil, Alkylcarbonyloxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Alkoxy carbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil, Hydroximinoalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkoximinoalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil und 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen und/oder Heterocyclyl mit 3 bis 8 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel,

oder

für Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkinyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen stehen, wobei die drei zuvor genannten Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Alkoxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkylsulfinyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkylsulfonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkenyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkinyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkylthio mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkylsulfinyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkylsulfonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkenyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkenylthio mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkenylsulfinyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkenylsulfonyl mit

- 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkinyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkinylthio mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkinylsulfinyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Halogenalkinylsulfonyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen, Alkylamino mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Dialkylamino mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in jedem Alkylteil, Alkylcarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Alkylcarbonyloxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil, Alkylaminocarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Dialkylaminocarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in jedem Alkylteil, Alkylaminothiocarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Dialkylaminothiocarbonyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in jedem Alkylteil, Hydroximinoalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, Alkoximinoalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil und 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen und/oder Heterocyclyl mit 3 bis 8 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel,
- 20  $R^3$  für fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, wie Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel, steht, wobei diese Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch
- Halogen, Cyano, Nitro, Formyl;
- 25 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;
- jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy oder
- 30 Alkinyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

- jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;
- 5
- jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl, Halogenalkinyl, Halogenalkenyloxy oder Halogenalkinyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;
- 10
- jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy carbonyl, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;
- 15
- und/oder
- Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,
- oder
- 20
- $R^3$  für Aryl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis fünffach, gleichartig oder verschieden substituiert ist durch
- Halogen, Cyano, Nitro, Formyl;
- 25
- jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;
- jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy oder
- 30
- Alkinyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;



jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

5

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl, Halogenalkinyl, Halogenalkenyloxy oder Halogenalkinyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

10

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy carbonyl, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

15

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

20

zweifach verknüpftes Alkylen mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl und/oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen,

25

zweifach verknüpftes Oxyalkylen mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl und/oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen,

und/oder

30

zweifach verknüpftes Dioxyalkylen mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, wobei die Sauerstoffatome jedoch nicht benachbart stehen und wobei die Alkylkette einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann

durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl und/oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen,

wobei aber mindestens ein Substituent aus der folgenden Gruppe von Resten vorhanden ist

Formyl,

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl, Halogenalkinyl, Halogenalkenyloxy oder Halogenalkinyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen,

zweifach verknüpftes Alkylen mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl und/oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen,

zweifach verknüpftes Oxyalkylen mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl und/oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

zweifach verknüpftes Dioxyalkylen mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, wobei die Sauerstoffatome jedoch nicht benachbart stehen und wobei die Alkylenkette einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl und/oder Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen,

und

X für Fluor, Chlor oder Brom steht.

Besonders bevorzugt sind diejenigen Stoffe der Formel (I), in denen

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> unabhängig voneinander für Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-, i-, sek.- oder tert.-Butyl, Pentyl oder Hexyl stehen, wobei diese Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sind durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thio-carbamoyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Trichlorethinythio, Trifluorethinythio, Chlorallythio, Iodpropargylthio, Trichlorethinylsulfinyl, Trifluorethinylsulfinyl, Chlorallylsulfinyl, Iodpropargylsulfinyl, Trichlorethinylsulfonyl, Trifluorethinylsulfonyl, Chlorallylsulfonyl, Iodpropargylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Methylaminothiocarbonyl, Ethylaminothiocarbonyl, n- oder i-Propylaminothiocarbonyl, Dimethylaminothiocarbonyl, Diethyl-

aminothiocarbonyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinomethyl oder Ethoximinomethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, Phenyl, Pyridyl, Furyl, Thienyl, Dioxolanyl, Oxazolidinyl, Dithiolanyl, Methyl-dioxolanyl, Methyl-oxazolidinyl oder Methyl-dithiolanyl

oder

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> unabhängig voneinander für Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Pentenyl, Hexenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Hexinyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl stehen, wobei diese Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Trichlorethinyllthio, Trifluorethinyllthio, Chlorallyllthio, Iodpropargyllthio, Trichlorethinylsulfinyl, Trifluorethinylsulfinyl, Chlorallylsulfinyl, Iodpropargylsulfinyl, Trichlorethinylsulfonyl, Trifluorethinylsulfonyl, Chlorallylsulfonyl, Iodpropargylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximino-methyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, Phenyl, Pyridyl, Furyl Thienyl, Dioxolanyl, Oxazolidinyl,

Dithiolanyl, Methyl-dioxolanyl, Methyl-oxazolidinyl oder Methyl-dithiolanyl,

5  $R^3$  für Furyl, Thienyl, Pyridyl oder Pyrimidyl steht, wobei diese Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl, 10 Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, 15 Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximino-methyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

20 oder

$R^3$  für Phenyl steht, das einfach bis fünffach, gleichartig oder verschieden substituiert ist durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, 25 Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethyl-

amino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl, jeweils zweifach verknüpftes Propan-1,3-diyl, Methylendioxy oder Ethylendioxy, wobei diese Reste einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, wobei aber mindestens ein Substituent aus der folgenden Gruppe von Resten vorhanden ist, Formyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl, jeweils zweifach verknüpftes Propan-1,3-diyl, Methylendioxy oder Ethylendioxy, wobei diese Reste einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl, und

X für Fluor oder Chlor steht.

Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können auch einzelne Bedeutungen entfallen.

Eine ganz besonders bevorzugte Gruppe erfindungsgemäßer Verbindungen sind diejenigen Triazolopyrimidine der Formel (I), in denen

R<sup>1</sup> für Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-, i-, sek- oder tert-Butyl steht, wobei diese Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sind durch Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Acetyl, Dimethylaminocarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl oder Phenyl,  
 5 oder

R<sup>1</sup> für Propenyl, Butenyl, Pentenyl oder Hexenyl steht, wobei diese Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor und/oder Brom,

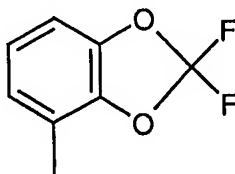
10

R<sup>2</sup> für Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-, i-, sek- oder tert.-Butyl steht, wobei diese Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sind durch Fluor, Chlor und/oder Brom,

15 R<sup>3</sup> für Phenyl steht, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert ist durch Fluor, Chlor, Trifluormethyl oder Trifluormethylthio, wobei aber mindestens ein Substituent eine Trifluormethyl- oder Trifluormethylthio-Gruppe ist, oder

20

R<sup>3</sup> für den Rest der Formel



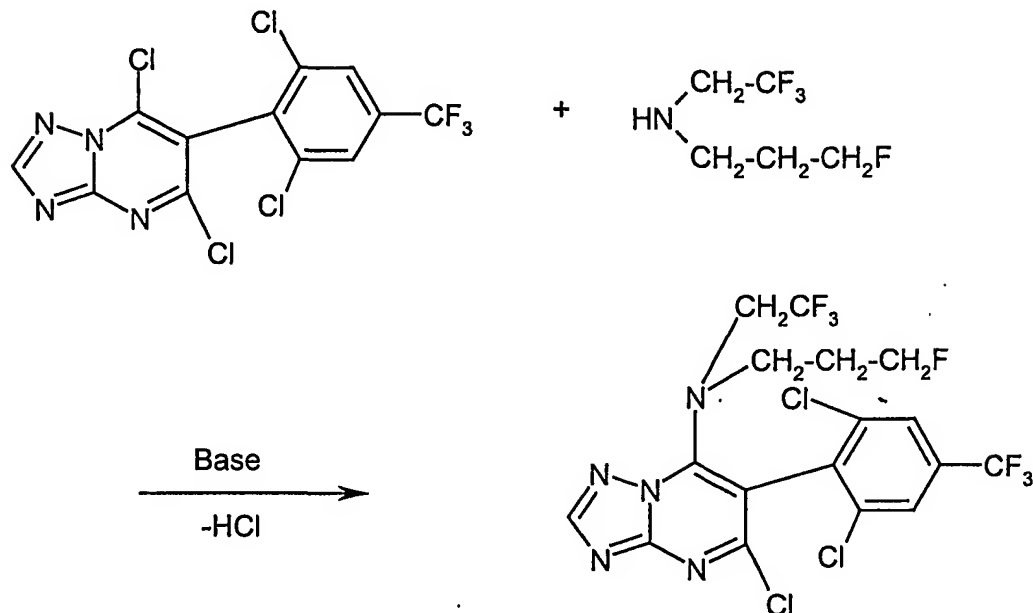
steht, und

25

X für Fluor oder Chlor steht.

Verwendet man 5,7-Dichlor-6-(2,6-dichlor-4-trifluormethyl-phenyl)-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]-pyrimidin und 2,2,2-Trifluorethyl-3-fluor-propyl-amin als Ausgangsstoffe, so

kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



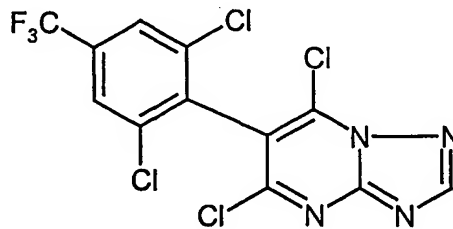
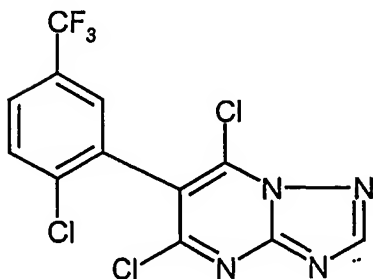
5

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens als Ausgangsstoffe benötigten Dihalogen-triazolopyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel haben  $R^3$  und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden. Y steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

10

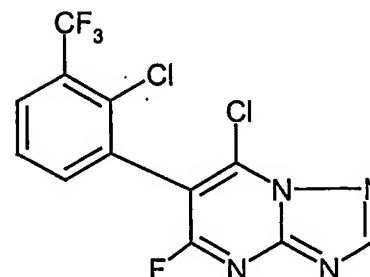
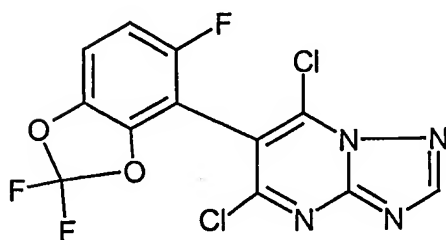
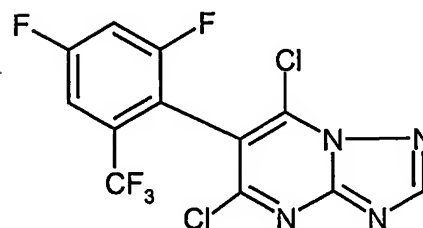
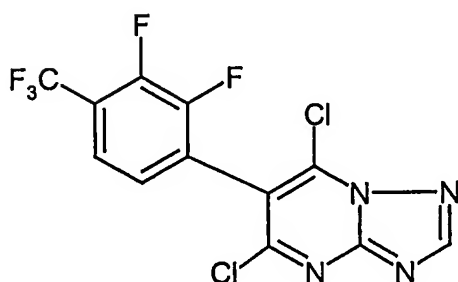
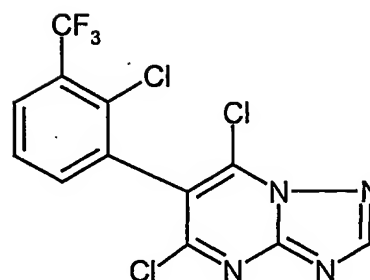
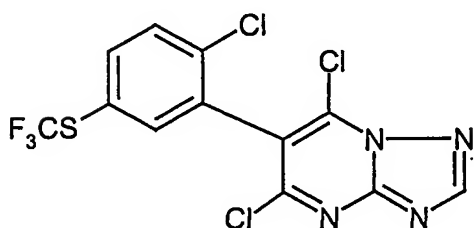
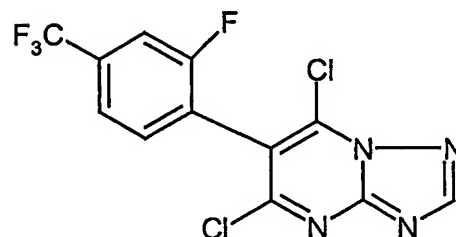
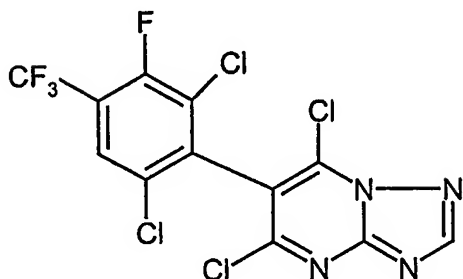
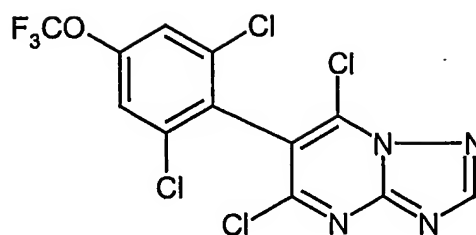
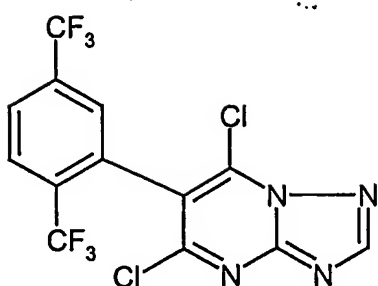
Als Beispiele für Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel (II) seien die Stoffe der folgenden Formeln genannt.

15





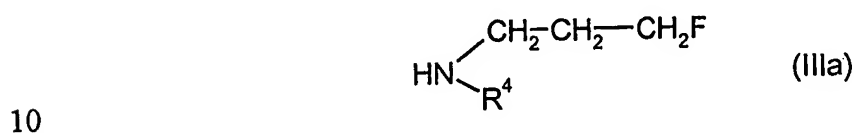
- 16 -



Die Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel (II) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. US 5 808 066, US 5 612 345 und WO 94-20 501).

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel haben  $R^1$  und  $R^2$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

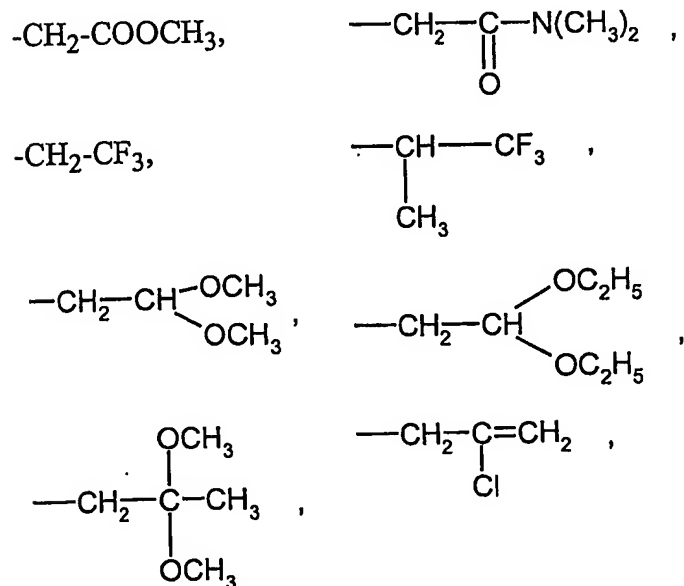
Amine der Formel



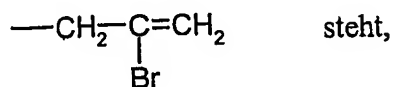
in welcher

$R^4$  für die Reste der Formeln

15



oder



sind neu.

Amine der Formel (IIIa) lassen sich herstellen, indem man entweder

- 5      a)      1-Fluor-3-brom-propan der Formel



mit Aminen der Formel

10



in welcher

15

$\text{R}^4$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

oder mit Säureadditions-Salzen von Aminen der Formel (V)

20

in Gegenwart eines inerten organischen Verdünnungsmittels, wie zum Beispiel Acetonitril, und in Gegenwart eines Säurebindemittels, wie zum Beispiel Kaliumcarbonat, bei Temperaturen zwischen 10°C und 80°C umsetzt,

oder

25

- b)      3-Fluor-propyl-amin der Formel



30

gegebenenfalls in Form eines Säureadditions-Salzes

mit Halogenverbindungen der Formel



5 in welcher

$\text{R}^4$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und

Hal für Chlor oder Brom steht,

10

in Gegenwart eines inerten Verdünnungsmittels, wie zum Beispiel Acetonitril, und in Gegenwart eines Säurebindemittels, wie zum Beispiel Kaliumcarbonat, bei Temperaturen zwischen 10°C und 80°C umgesetzt.

15 Das bei der Durchführung des Verfahrens (a) als Ausgangsstoff benötigte 1-Fluor-3-brom-propan der Formel (IV) ist bisher noch nicht bekannt. Es lässt sich herstellen, indem man zunächst 3-Chlor-1-propanol mit Kaliumfluorid in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie zum Beispiel Triethylenglykol, bei Temperaturen zwischen 50°C und 180°C umsetzt und dann in einem zweiten Schritt das entstandene 3-Fluor-  
20 1-propanol mit Thionylbromid in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie zum Beispiel Dimethylformamid, bei Temperaturen zwischen 0°C und 30°C umsetzt.

Die bei der Durchführung des Verfahrens (a) als Reaktionskomponenten benötigten Amine der Formel (V) werden entweder als solche oder in Form von  
25 Säureadditions-Salzen eingesetzt. Bevorzugt sind dabei Ammonium-Salze, die durch Addition von Chlorwasserstoff oder Tosylchlorid an Amine der Formel (V) entstehen.

Die Amine der Formel (V) und deren Säureadditions-Salze sind bekannt oder lassen  
30 sich nach bekannten Methoden herstellen.

Das bei der Durchführung des Verfahrens (b) als Ausgangsstoff benötigte 3-Fluorpropyl-amin der Formel (VI) und dessen Säureadditions-Salze lassen sich herstellen, indem man zunächst 3-Fluor-1-propanol mit Tosylchlorid in Gegenwart eines Säurebindemittels, wie zum Beispiel Pyridin, bei Temperaturen zwischen -10°C und +10°C umsetzt und dann in einem zweiten Schritt das entstandene 3-Fluorpropyl-tosylat in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie zum Beispiel Ethanol, bei Temperaturen zwischen 10°C und 30°C mit Ammoniak behandelt. Aus dem anfallenden 3-Fluorpropyl-ammonium-tosylat kann durch Behandeln mit wässrigem Alkalimetallhydroxid das Amin in Freiheit gesetzt werden. Letzteres lässt sich durch Umsetzung mit Säuren in die entsprechenden Säureadditions-Salze überführen.

Bevorzugt sind die Ammonium-Salze, die durch Addition von Chlorwasserstoff oder Tosylchlorid an das 3-Fluorpropyl-amin der Formel (VI) entstehen.

Die bei der Durchführung des Verfahrens (b) als Reaktionskomponenten benötigten Halogenverbindungen der Formel (VII) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

In analoger Weise wie die Amine der Formel (IIIa) lassen sich auch die übrigen Amine der Formel (III) herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens alle üblichen inerten, organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid,

N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

5 Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens alle für derartige Umsetzungen üblichen Säurebindemittel in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan  
10 (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen  
15 zwischen 0°C und 80°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens setzt man auf 1 Mol an Dihalogen-triazolopyrimidin der Formel (II) im allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol an Amin der Formel (III) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach  
20 üblichen Methoden.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck, im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar, zu arbeiten.

25 Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

- 5 Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

- 10 Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;  
Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;  
Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;  
15 Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;  
Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;  
Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder *Pseudoperonospora cubensis*;  
Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;  
20 Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;  
Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;  
Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;  
Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;  
Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;  
25 Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;  
Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*  
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);  
Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*  
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);  
30 Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;  
Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;

Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;

Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;

5 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;

Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;

Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;

Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;

10 Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;

Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.

15 Die gute Pflanzenverträglichkeit der erfindungsgemäßen Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

20 Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Erysiphe- oder Puccinia-Arten, von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Venturia-, Uncinula- und Podosphaera-Arten, oder von Reiskrankheiten, wie beispielsweise gegen Pyricularia-Arten, einsetzen.

25 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

30 Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.



Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, 5 Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt 10 werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

15 Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,  
Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,  
Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,  
20 Coniophora, wie *Coniophora puetana*,  
Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,  
Penicillium, wie *Penicillium versicolor*,  
Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,  
Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,  
25 Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,  
Escherichia, wie *Escherichia coli*,  
Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,  
Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

30 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, ins-

besondere von Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Gartenbau, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor bzw. im veterinärmedizinischen Bereich vorkommen. Die Stoffe sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen Schädlinge in allen oder einzelnen Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten tierischen Schädlingen gehören:

5 Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

10 Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera spec.*

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera immaculata*.

15 Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.

20 Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa spp.*, *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

25 Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes spp.*

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*

30 Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. *Trichodectes spp.*, *Damalinea spp.*

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

5 Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*,  
*Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

10 Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*,  
*Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*,  
*Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.

15 Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*,  
*Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp.,  
*Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp.,  
20 *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Spodoptera exigua*, *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*,  
*Spodoptera litura*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*,  
*Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*,  
*Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*,  
*Tortrix viridana*.

25

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*,  
*Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*,  
*Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*,  
*Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*,  
30 *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*,  
*Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp.,

Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica.

5

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

10

Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa.

15

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp.

Aus der Ordnung der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans.

20

Aus der Ordnung der Acarina z.B. Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptura oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp.

25

Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp.

30

Die erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe lassen sich mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Milben, wie gegen die Bohnenspinnmilbe (*Tetranychus urticae*), oder zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Insekten, wie gegen die Larven des Meerrettichblattkäfers (*Phaedon cochleariae*), sowie der grünen Pfirsichblattlaus (*Mycus persicae*) einsetzen.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen *Candida*-Spezies wie *Candida albicans*, *Candida glabrata*) wie *Epidermophyton floccosum*, *Aspergillus*-Spezies wie *Aspergillus niger* und *Aspergillus fumigatus*, *Trichophyton*-Spezies wie *Trichophyton mentagrophytes*, *Microsporon*-Spezies wie *Microsporon canis* und *audouinii*. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, alipha-

tische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Stoffe in Frage:

**Fungizide:**

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Carpropamid,

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluamid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenciclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, 5 Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox, Fenhexamid,

Guazatin,

10

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, 15 Isovaledione, Iprovalicarb,

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

20

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

25

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

30

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb,



Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

Quinconazol, Quintozen (PCNB), Quinoxifen,

5

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Spiroxamine,

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol, Trifloxystrobin,

10

- Uniconazol,

15

Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

Dagger G,

OK-8705,

20

OK-8801,

$\alpha$ -(1,1-Dimethylethyl)- $\beta$ -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

$\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -fluor-b-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

$\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -methoxy-a-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

$\alpha$ -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- $\beta$ -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

25

(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,

(E)-a-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,

1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,

1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,

30

1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,

1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,

- 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,  
 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,  
 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,  
 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,  
 5 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,  
 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,  
 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,  
 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,  
 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,  
 10 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,  
 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-  
 methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,  
 2-Aminobutan,  
 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,  
 15 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,  
 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyantomethyl)-acetamid,  
 2-Phenylphenol(OPP),  
 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,  
 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,  
 20 3-(1,1-Dimethylpropyl)-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,  
 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,  
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,  
 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,  
 8-Hydroxychinolinsulfat,  
 25 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,  
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,  
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,  
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl]-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-  
 hydrochlorid,  
 30 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,  
 Kaliumhydrogencarbonat,

- Methantetrathiol-Natriumsalz,  
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,  
 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,  
 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,  
 5 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,  
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,  
 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,  
 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
 10 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,  
 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,  
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,  
 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,  
 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,  
 15 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,  
 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,  
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiaazol-7-carbothioat,  
 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,

20 **Bakterizide:**

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-Dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Othilinin, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

25

**Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

- Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,  
 Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin,  
 30 Azamethphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, 5 Butocarboxim, Butylpyridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin, 10 Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, 15 Docusat-sodium, Dofenapyn,

Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopftora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, 20 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazuron, Flubrocycythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

25 Granuloseviren

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,

30 Imidacloprid, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,

Kernpolyederviren

Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

5 Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazon, Mevinphos, Milbemectin, Monocrotophos,

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

10

Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, 15 Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,

Quinalphos,

20

Ribavirin

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos,

25 Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temiviphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Theta-cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Traloccythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, 30 Triflumuron, Trimethacarb,

Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

YI 5302

5 Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-  
furanlyden)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat

(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat

10 1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-  
imin

2-(2-Chlor-6-fluorphenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol

2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion

2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

15 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid  
3-Methylphenyl-propylcarbammat

4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol

4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-  
3(2H)-pyridazinon

20 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-  
pyridazinon

4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon

Bacillus thuringiensis strain EG-2348

Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid

25 Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-  
ester

[3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid

Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd

Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbammat

30 N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin

N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid

N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin

N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid

5 N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

10

Mit den erfindungsgemäßen Stoffen lassen sich alle Pflanzen und Pflanzenteile behandeln. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können

15

Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen

20 Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

25

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen,

30 Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoff-

zubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

5 Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwand-  
mengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden.  
Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im  
allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha.  
Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen  
zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und  
10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwand-  
10 mengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise  
zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile  
15 behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild  
vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung  
oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren  
Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene  
Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls  
20 in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified  
Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von  
Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen  
25 oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbe-  
dingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die  
erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auf-  
30 treten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen  
des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungs-



gemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität  
5 und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnolo-  
10 gisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material enthalten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegen-  
über hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder  
15 gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche  
Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikro-  
20 bielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und  
25 Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen)  
30 in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften

("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als herbizid-resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die zum Schutz technischer Materialien verwendeten Mittel enthalten die Wirkstoffe im allgemeinen in einer Menge von 1 bis 95 %, bevorzugt von 10 bis 75 %.

Die Anwendungskonzentrationen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe richten sich nach der Art und dem Vorkommen der zu bekämpfenden Mikroorganismen sowie nach der Zusammensetzung des zu schützenden Materials. Die optimale Einsatzmenge kann durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen liegen die Anwendungs-

5 konzentrationen im Bereich von 0,001 bis 5 Gew.-%, vorzugsweise von 0,05 bis 1,0 Gew.-%, bezogen auf das zu schützende Material.

Die Wirksamkeit und das Wirkungsspektrum der erfindungsgemäß im Materialschutz zu verwendenden Wirkstoffe bzw. der daraus herstellbaren Mittel, Konzentrate oder ganz allgemein Formulierungen kann erhöht werden, wenn gegebenenfalls

10 weitere antimikrobiell wirksame Verbindungen, Fungizide, Bakterizide, Herbizide, Insektizide oder andere Wirkstoffe zur Vergrößerung des Wirkungsspektrums oder Erzielung besonderer Effekte wie z.B. dem zusätzlichen Schutz vor Insekten zugesetzt werden. Diese Mischungen können ein breiteres Wirkungsspektrum besitzen als

15 die erfindungsgemäßen Verbindungen.

Auch beim Einsatz gegen tierische Schädlinge können die erfindungsgemäßen Stoffe in handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind

20 Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne dass der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muss.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der

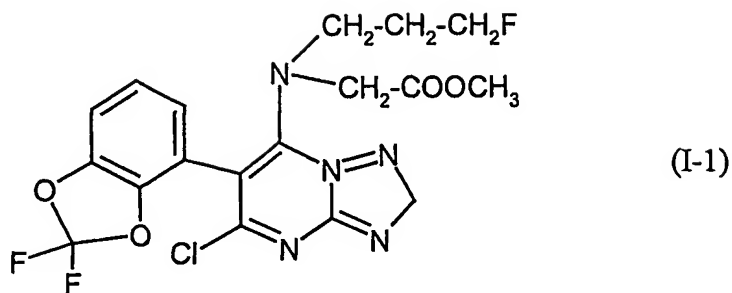
25 Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepassten üblichen Weise.

- 43 -

Bei der Anwendung gegen Hygiene- und Vorratsschädlinge zeichnet sich der Wirkstoff durch eine hervorragende Residualwirkung auf Holz und Ton sowie durch eine gute Alkalistabilität auf gekalkten Unterlagen aus.

- 5 Die Erfindung wird durch die folgenden Beispiele veranschaulicht.

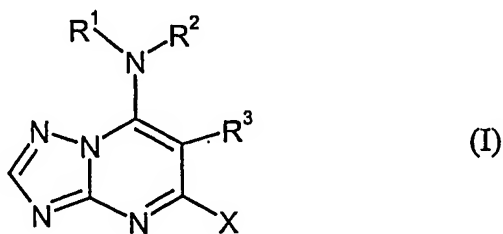
HerstellungsbeispieleBeispiel 1

5

Ein Gemisch aus 0,1 g (0,29 mmol) 5,7-Dichlor-6-(2,2-difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-[1,2,4]-triazolo[1,5a]-pyrimidin und 0,04 g (0,29 mmol) (3-Fluorpropyl)-(methoxycarbonyl-methyl)-amin in 6,6 g Acetonitril wird mit 0,04 g (0,29 mmol) Kaliumcarbonat versetzt und 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch filtriert und unter vermindertem Druck eingeeengt. Der verbleibende Rückstand wird mit n-Hexan:Ethylacetat = 3:1 als Laufmittel an Kieselgel chromatographiert. Nach dem Einengen des Eluates erhält man 0,1 g (64,8 % der Theorie) an der Substanz der oben angegebenen Formel mit einem log P-Wert (S) von 2,93.

15

In analoger Weise werden die in der folgenden Tabelle 1 aufgeführten Triazolo-pyrimidine der Formel



20

erhalten.

**Tabelle 1**

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	logP
2	-CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylphenyl	-Cl	2,77
3	-CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2,5-Bis-(trifluor-methyl)-phenyl	-Cl	2,89
4	-CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-Cl	3,01
5	-CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2-Fluor-4-trifluor-methylphenyl	-Cl	2,71
6	-CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylthio-phenyl	-Cl	3,14
7	-CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-3-trifluor-methylphenyl	-Cl	2,71
8	-CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2,2-Difluor-1,3-benzo-dioxol-4-yl	-Cl	2,52
9	-CH <sub>2</sub> -CO-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2,3-Difluor-4-trifluor-methyl-phenyl	-Cl	2,86
10	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,23
11	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2,5-Bis-(trifluor-methyl)-phenyl	-Cl	
12	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-Cl	3,58
13	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Fluor-4-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,17
14	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylthio-phenyl	-Cl	3,57
15	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-3-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,17
16	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2,3-Difluor-4-trifluor-methyl-phenyl	-Cl	3,29
17	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,54
18	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2,5-Bis-(trifluor-methyl)-phenyl	-Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	logP
19	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-Cl	3,82
20	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2-Fluor-4-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,41
21	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylthio-phenyl	-Cl	3,90
22	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-3-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,42
23	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl	-Cl	3,24
24	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2,3-Difluor-4-trifluor-methyl-phenyl	-Cl	3,55
25	2,2-Diethoxy-ethyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylphenyl	-Cl	4,10
26	2,2-Diethoxy-ethyl	3-Fluorpropyl	2,5-Bis-(trifluor-methyl)-phenyl	-Cl	
27	2,2-Diethoxy-ethyl	3-Fluorpropyl	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-Cl	4,45
28	2,2-Diethoxy-ethyl	3-Fluorpropyl	2-Fluor-4-trifluor-methylphenyl	-Cl	4,04
29	2,2-Diethoxy-ethyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylthio-phenyl	-Cl	4,47
30	2,2-Diethoxy-ethyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-3-trifluor-methylphenyl	-Cl	4,00
31	2,2-Diethoxy-ethyl	3-Fluorpropyl	2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl	-Cl	3,81
32	2,2-Diethoxy-ethyl	3-Fluorpropyl	2,3-Difluor-4-trifluor-methyl-phenyl	-Cl	4,16
33	-CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,07
34	2,2-Dimethoxypropyl	3-Fluorpropyl	2,5-Bis-(trifluor-methyl)-phenyl	-Cl	
35	2,2-Dimethoxypropyl	3-Fluorpropyl	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	logP
36	-CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Fluor-4-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,01
37	-CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylthio-phenyl	-Cl	3,42
38	-CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-3-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,01
39	-CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2,2-Difluor-1,3-benzo-dioxol-4-yl	-Cl	2,80
40	-CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2,3-Difluor-4-trifluor-methyl-phenyl	-Cl	3,14
41	2-Bromallyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluormethylphenyl	-Cl	3,92
42	2-Bromallyl	3-Fluorpropyl	2,5-Bis-(trifluor-methyl)-phenyl	-F	3,84
43	2-Bromallyl	3-Fluorpropyl	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-Cl	4,27
44	2-Bromallyl	3-Fluorpropyl	2-Fluor-4-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,85
45	2-Bromallyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylthio-phenyl	-Cl	4,36
46	2-Bromallyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-3-trifluor-methylphenyl	-F	3,73
47	2-Bromallyl	3-Fluorpropyl	2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl	-Cl	3,69
48	2-Bromallyl	3-Fluorpropyl	2,3-Difluor-4-trifluor-methyl-phenyl	-Cl	3,94
49	2-Chlorallyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,84
50	2-Chlorallyl	3-Fluorpropyl	2,5-Bis-(trifluor-methyl)-phenyl	-F	3,77
51	2-Chlorallyl	3-Fluorpropyl	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-Cl	4,19
52	2-Chlorallyl	3-Fluorpropyl	2-Fluor-4-trifluor-methylphenyl	-Cl	3,77

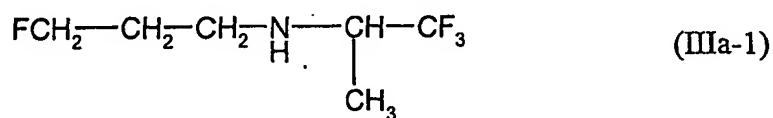


Tabelle 1 (Fortsetzung)

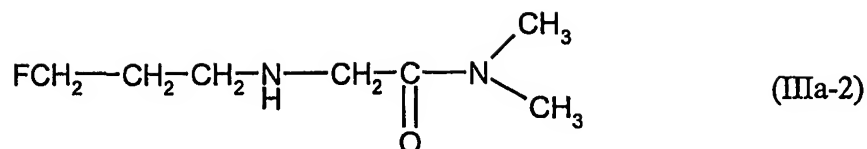
Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	logP
53	2-Chlorallyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylthio-phenyl	-Cl	4,27
54	2-Chlorallyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-3-trifluor-methylphenyl	-F	3,66
55	2-Chlorallyl	3-Fluorpropyl	2,2-Difluor-1,3-benzo-dioxol-4-yl	-Cl	3,61
56	2-Chlorallyl	3-Fluorpropyl	2,3-Difluor-4-trifluor-methyl-phenyl	-Cl	3,86
57	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylphenyl	-Cl	
58	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2,5-Bis-(trifluor-methyl)-phenyl	-Cl	
59	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-Cl	
60	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Fluor-4-trifluor-methylphenyl	-Cl	
61	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylthio-phenyl	-Cl	
62	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2-Chlor-3-trifluor-methylphenyl	-Cl	
63	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2,2-Difluor-1,3-benzo-dioxol-4-yl	-Cl	
64	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2,3-Difluor-4-trifluor-methyl-phenyl	-Cl	
65	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylphenyl	-Cl	
66	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	3-Fluorpropyl	2,5-Bis-(trifluor-methyl)-phenyl	-Cl	
67	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	3-Fluorpropyl	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-Cl	
68	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	3-Fluorpropyl	2-Fluor-4-trifluor-methylphenyl	-Cl	
69	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-5-trifluor-methylthio-phenyl	-Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	logP
70	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	3-Fluorpropyl	2-Chlor-3-trifluor-methylphenyl	-Cl	
71	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	3-Fluorpropyl	2,2-Difluor-1,3-benzo-dioxol-4-yl	-Cl	
72	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	3-Fluorpropyl	2,3-Difluor-4-trifluor-methyl-phenyl	-Cl	
73	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Fluorpropyl	2,4-Difluor-6-trifluor-methyl-phenyl	-Cl	3,22
74	-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	3-Fluorpropyl	2,4-Difluor-6-trifluormethyl-phenyl	-Cl	2,92

Herstellung von Ausgangssubstanzen5 Beispiel 75

- 10 Ein Gemisch aus 10,0 g (88,43 mmol) 2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethylamin und 6,11 g (44,22 mmol) Kaliumcarbonat in 78,00 g Acetonitril wird bei Raumtemperatur unter Rühren innerhalb von 30 Minuten mit 12,47 g (88,43 mmol) 1-Fluor-3-brom-propan versetzt. Nach beendeter Zugabe wird das Reaktionsgemisch 16 Stunden bei
- 15 Raumtemperatur gerührt und dann filtriert. Das Filtrat wird zunächst unter vermindertem Druck eingengt und dann unter Atmosphärendruck destilliert. Man erhält auf diese Weise 2,1 g (12,34 % der Theorie) an (3-Fluorpropyl)-(2,2,2-trifluor-1-methyl-ethyl)-amin in Form einer Flüssigkeit.

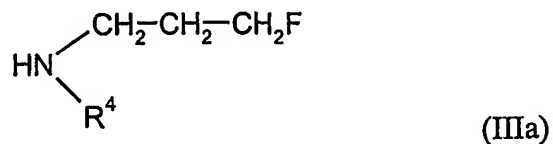
**Beispiel 76**

5 Ein Gemisch aus 10,0 g (40,11 mmol) 3-Fluor-propyl-ammonium-tosylat und 156,0 g Acetonitril wird mit 8,32 g (60,17 mmol) Kaliumcarbonat versetzt und 1 Stunde bei Raumtemperatur gerührt. Danach fügt man 4,88 g (40,11 mmol) 2-Chlor-N,N-dimethylacetamid hinzu und rührt 24 Stunden bei Raumtemperatur. Anschließend wird das Reaktionsgemisch filtriert. Das Filtrat wird unter vermin-

10 dertem Druck eingeeengt. Der verbleibende Rückstand wird unter stark vermindertem Druck destilliert. Man erhält auf diese Weise 1,3 g (17,98 % der Theorie) an (3-Fluorpropyl)-(N,N-dimethylcarbonyl-methyl)-amin in Form einer Flüssigkeit.

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der folgenden Tabelle 2

15 aufgeführten Amine der Formel



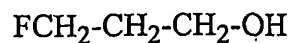
erhalten.

**Tabelle 2**

Bsp. Nr.	R <sup>4</sup>	Siedepunkt (°C)
77	$\text{---CH}_2\text{---}\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{C}}}\text{---OCH}_3$	97-103 / 19 mbar
78	$\text{---CH}_2\text{---CF}_3$	90-103 70 / 15 mbar
79	$\text{---CH}_2\text{---}\overset{\text{Cl}}{\underset{\text{Cl}}{\text{C}}}\text{=CH}_2$	70 / 15 mbar
80	$\text{---CH}_2\text{---}\overset{\text{Br}}{\underset{\text{Br}}{\text{C}}}\text{=CH}_2$	90 / 16 mbar
81	$\text{---CH}_2\text{---CH}\begin{matrix} \text{OC}_2\text{H}_5 \\ \text{OC}_2\text{H}_5 \end{matrix}$	62-66 / 1,3 mbar
82	$\text{---CH}_2\text{---CH}\begin{matrix} \text{OCH}_3 \\ \text{OCH}_3 \end{matrix}$	52-55 / 2 mbar
83	$\text{---CH}_2\text{---}\overset{\text{OCH}_3}{\underset{\text{OCH}_3}{\text{C}}}\text{---CH}_3$	48-49 / 2 mbar

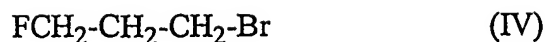
**Beispiel 84**

5

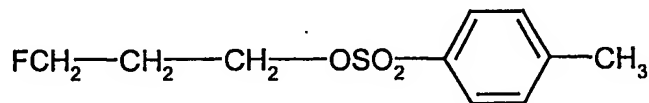


10

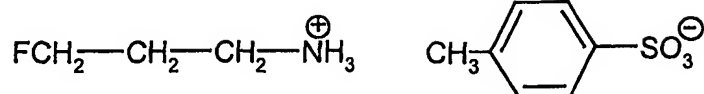
Man rührt ein Gemisch aus 235,5 g (4,0 Mol) Kaliumfluorid und 787,5 g Triethylenglykol 1 Stunde bei 100°C, destilliert dann 200 ml Triethylenglykol ab, lässt auf Raumtemperatur abkühlen und fügt 128,0 g (1,353 Mol) 3-Chlor-1-propanol hinzu. Das Reaktionsgemisch wird 2 Stunden auf 180°C erhitzt und dann unter vermindertem Druck destilliert. Man erhält 67,6 g (63,95 % der Theorie) an 3-Fluor-1-propanol in Form einer Flüssigkeit.

**Beispiel 85**

- 5 Ein Gemisch aus 67,6 g (0,865 mol) 3-Fluor-1-propanol in 190 g Dimethylformamid wird bei Raumtemperatur unter Kühlung und unter Rühren innerhalb von 2 Stunden mit 200 g (0,962 mol) Thionylbromid versetzt. Nach beendeter Zugabe wird noch 2 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt und dann unter vermindertem Druck destilliert. Man erhält 47,2 g (37,5 % der Theorie) an 1-Fluor-3-brom-propan in Form  
10 einer Flüssigkeit vom Siedepunkt 100-103°C.

**Beispiel 86**

- 15 Ein Gemisch aus 2,81 g (36 mmol) 3-Fluor-1-propanol und 30 ml Pyridin wird bei 0°C innerhalb von 5 Minuten unter Rühren mit 13,73 g (72 mmol) 4-Tosylchlorid versetzt. Man rührt das Reaktionsgemisch nach beendeter Zugabe noch 1 Stunde bei 0°C, fügt dann bei -10°C innerhalb von 5 Minuten 2,7 ml Wasser hinzu und versetzt  
20 anschließend mit 30 ml Wasser. Zur Aufarbeitung gießt man das Reaktionsgemisch in 1 Liter Wasser und extrahiert das entstehende Gemisch dreimal mit Ether. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit Wasser gewaschen und dann unter vermindertem Druck eingengt. Man erhält auf diese Weise 7,1 g (84,9 % der Theorie) an 3-Fluor-propyl-tosylat.

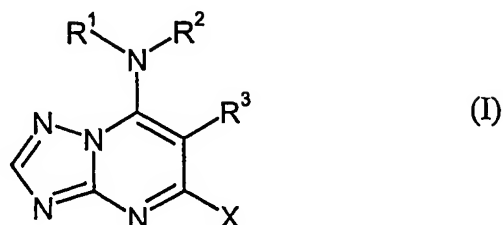
**Beispiel 87**

- 5 In eine Lösung von 96,0 g (415 mmol) 3-Fluor-propyl-tosylat in 500 ml Ethanol werden bei Raumtemperatur innerhalb von 2,5 Stunden 84,0 g (4,932 mol) Ammoniak eingeleitet. Danach rührt man das Reaktionsgemisch, zunächst 16 Stunden bei Raumtemperatur und dann noch 1 Stunde unter Rückfluß. Zur
- 10 aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch unter vermindertem Druck eingengt. Der verbleibende Rückstand wird nacheinander mit Ethylacetat und mit Ether gewaschen.

Man erhält auf diese Weise 43,2 g (41,67 % der Theorie) an 3-Fluor-propyl-ammonium-tosylat.

Patentansprüche

## 1. Triazolopyrimidine der Formel



5

in welcher

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> unabhängig voneinander für Alkyl stehen, das einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert ist durch Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl, Halogenalkylsulfonyl, Halogenalkenyloxy, Halogenalkenylthio, Halogenalkenylsulfinyl, Halogenalkenylsulfonyl, Halogenalkinyloxy, Halogenalkinylthio, Halogenalkinylsulfinyl, Halogenalkinylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy carbonyl, Hydroximinoalkyl, Alkoximinoalkyl, Cycloalkyl, Aryl und/oder Heterocyclyl,

15

20

oder

für gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl stehen,

25

R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht oder für substituiertes Aryl steht, wobei aber mindestens ein Substituent aus der folgenden Gruppe von Resten vorhanden ist

Formyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl, Halogenalkylsulfonyl, Halogenalkenyl, Halogenalkinyl, Halogenalkenyloxy, Halogenalkinyloxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl,

zweifach verknüpftes Alkylen mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, das einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,

zweifach verknüpftes Oxyalkylen mit 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, das einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,

zweifach verknüpftes Dioxyalkylen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, wobei die Sauerstoffatome jedoch nicht benachbart stehen und wobei die Alkylenkette einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,

und

X für Halogen steht.

2. Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in denen

R<sup>1</sup> für Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-, i-, sek- oder tert-Butyl steht, wobei diese Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sind durch Fluor, Chlor, Brom, Methoxy,



Ethoxy, Acetyl, Dimethylaminocarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl oder Phenyl,  
oder

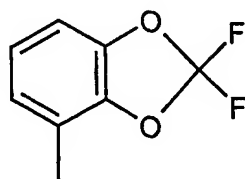
5             $R^1$     für Propenyl, Butenyl, Pentenyl oder Hexenyl steht, wobei diese Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor und/oder Brom,

10            $R^2$     für Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-, i-, sek- oder tert.-Butyl steht, wobei diese Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sind durch Fluor, Chlor und/oder Brom,

15            $R^3$     für Phenyl steht, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert ist durch Fluor, Chlor, Trifluormethyl oder Trifluormethylthio,

wobei aber mindestens ein Substituent eine Trifluormethyl- oder Trifluormethylthio-Gruppe ist, oder

20            $R^3$     für den Rest der Formel

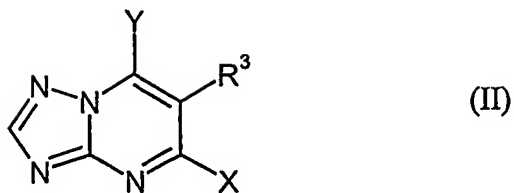


steht, und

25            $X$     für Fluor oder Chlor steht.

3. Verfahren zur Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel

- 57 -



in welcher

5

$R^3$  und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y für Halogen steht,

10

mit Aminen der Formel



in welcher

15

$R^1$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

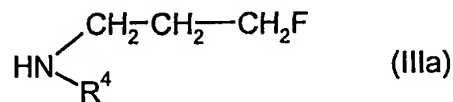
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umgesetzt.

20

4. Mittel zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen und tierischen Schädlingen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Triazolopyrimidin der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

25

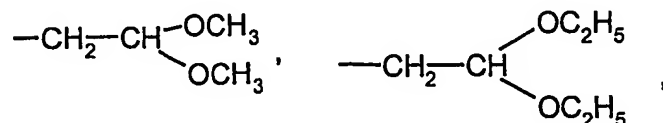
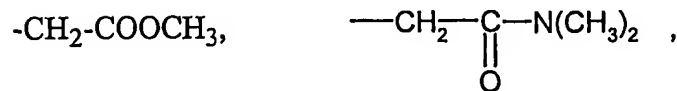
5. Verwendung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen und tierischen Schädlingen.
- 5 6. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen und tierischen Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die unerwünschten Mikroorganismen bzw. tierischen Schädlinge und/oder deren Lebensraum ausbringt.
- 10 7. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen und tierischen Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
- 15 8. Amine der Formel



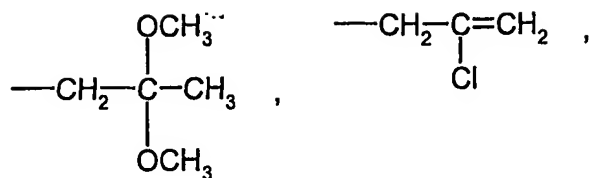
in welcher

20

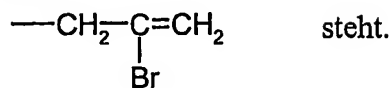
R<sup>4</sup> für die Reste der Formeln



- 59 -

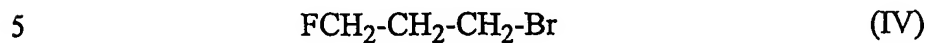


oder



9. Verfahren zur Herstellung von Aminen der Formel (IIIa) gemäß Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, dass man

- a) 1-Fluor-3-brom-propan der Formel



mit Aminen der Formel



in welcher

$\text{R}^4$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

15 oder mit Säureadditions-Salzen von Aminen der Formel (V)

in Gegenwart eines inerten organischen Verdünnungsmittels, und in Gegenwart eines Säurebindemittels, umsetzt,

20 oder

- b) 3-Fluor-propyl-amin der Formel

- 60 -



gegebenenfalls in Form eines Säureadditions-Salzes

5 mit Halogenverbindungen der Formel



in welcher

10

$\text{R}^4$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und

Hal für Chlor oder Brom steht,

15

in Gegenwart eines inerten Verdünnungsmittels, und in Gegenwart eines Säurebindemittels, umgesetzt.

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
27. Juni 2002 (27.06.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 02/050077 A3**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **C07D 487/04**,  
A01N 43/90, C07C 211/24

[DE/DE]; Am Sonnenhang 1, 42799 Leichlingen (DE).  
**HILGERS, Petra** [DE/DE]; Sandweg 10, 51503 Rösrath  
(DE). **PLESCHKE, Axel** [DE/DE]; Im Thurner Feld 41,  
51069 Köln (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/14415

(22) Internationales Anmeldedatum:  
7. Dezember 2001 (07.12.2001)

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER AKTIENGE-  
SELLSCHAFT**; 51368 Leverkusen (DE).

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,  
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,  
SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US,  
UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
100 63 115.0 18. Dezember 2000 (18.12.2000) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE];  
51368 Leverkusen (DE).

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,  
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),  
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,  
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **GEBAUER, Olaf**  
[DE/DE]; Jesuitengasse 111, 50737 Köln (DE). **ELBE,**  
**Hans-Ludwig** [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wup-  
pertal (DE). **HENRICH, Marielouise** [DE/DE]; Hey-  
mannstr. 38, 51373 Leverkusen (DE). **MARHOLD,**  
**Albrecht** [DE/DE]; Carl-Duisberg-Str. 329, 51373 Lev-  
erkusen (DE). **WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike**  
[DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE).  
**MAULER-MACHNIK, Astrid** [DE/DE]; Neuenkamper  
Weg 48, 42799 Leichlingen (DE). **KUCK, Karl-Heinz**  
[DE/DE]; Pastor-Loeh-Str. 30a, 40764 Langenfeld (DE).  
**VOERSTE, Arnd** [DE/DE]; Sahlierring 33, 50677  
Köln (DE). **KITAGAWA, Yoshinori** [JP/JP]; P.O. Box  
157, Tokyo, Tokyo 103-91 (JP). **HEINEMANN, Ulrich**

Veröffentlicht:

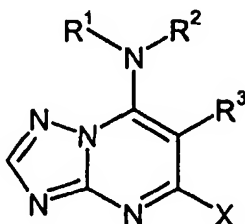
— mit internationalem Recherchenbericht

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen  
Recherchenberichts: 12. September 2002

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen  
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on  
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe  
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: TRIAZOLOPYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: TRIAZOLOPYRIMIDINE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to novel triazolopyrimidines of formula (I) in which R1, R2, R3 and X have the meaning given in the description, a method for the production of said novel materials and the use thereof for combating undesired micro-organisms and animal pests. The invention further relates to novel amines of formula (IIIa) in which R4 has the meanings given in the description and method for production thereof.

(57) Zusammenfassung: Neue Triazolopyrimidine der Formel (I) in welcher R1, R2, R3 und X die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, ein Verfahren zur Herstellung dieser neuen Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen und tierischen Schädlingen. Neue Amine der Formel (IIIa) in welcher R4 die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen hat, sowie Verfahren zu deren Herstellung.

WO 02/050077 A3

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 01/14415

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D487/04 A01N43/90 C07C211/24

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N C07C

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 98 46607 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22 October 1998 (1998-10-22) cited in the application claims; examples 12-47 ---	1-7
X	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7 July 1993 (1993-07-07) cited in the application claims; examples 20,46,98,101,109,111-114 -----	1-7

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&amp;" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

17 April 2002

Date of mailing of the international search report

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Schmid, A

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP01/14415

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

See supplemental sheet

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

1-7

**Remark on Protest**

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.



## ADDITIONAL MATTER PCT/ISA/210

The international search authority has established that this international application contains multiple inventions, as follows:

## 1. Claims: 1-7

Triazolopyrimidines of formula (I)

## 2. Claims: 8,9

Amines of formula IIIa and methods for production thereof

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/14415

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9846607	A	22-10-1998	AT 202779 T	15-07-2001
			AU 6576898 A	11-11-1998
			DE 69801048 D1	09-08-2001
			DE 69801048 T2	14-03-2002
			DK 975634 T3	24-09-2001
			EP 0975634 A1	02-02-2000
			ES 2160408 T3	01-11-2001
			PT 975634 T	28-12-2001
			WO 9846607 A1	22-10-1998
			ZA 9803055 A	11-10-1999
-----				
EP 0550113	A	07-07-1993	EP 0550113 A2	07-07-1993
			EP 0782997 A2	09-07-1997
			GR 3033916 T3	30-11-2000
			AT 159256 T	15-11-1997
			AT 192154 T	15-05-2000
			AU 667204 B2	14-03-1996
			AU 3043592 A	01-07-1993
			BR 9205172 A	06-07-1993
			CA 2086404 A1	01-07-1993
			CN 1075144 A ,B	11-08-1993
			CN 1141119 A ,B	29-01-1997
			DE 69222746 D1	20-11-1997
			DE 69222746 T2	12-02-1998
			DE 69230977 D1	31-05-2000
			DE 69230977 T2	09-11-2000
			DK 550113 T3	09-02-1998
			DK 782997 T3	07-08-2000
			ES 2108727 T3	01-01-1998
			ES 2147411 T3	01-09-2000
			GR 3025920 T3	30-04-1998
			HK 1010105 A1	23-06-2000
			HU 217349 B	28-01-2000
			IL 104244 A	13-07-1997
			JP 5271234 A	19-10-1993
			NZ 245581 A	26-07-1995
			PL 174047 B1	30-06-1998
			PL 171579 B1	30-05-1997
			PT 782997 T	29-09-2000
			RU 2089552 C1	10-09-1997
			SG 47563 A1	17-04-1998
			US 5593996 A	14-01-1997
			ZA 9210043 A	28-07-1993
-----				

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PC 01/14415

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 C07D487/04 A01N43/90 C07C211/24

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N C07C

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen,

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 98 46607 A (AMERICAN CYANAMID CO) 22. Oktober 1998 (1998-10-22) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche; Beispiele 12-47 ---	1-7
X	EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH) 7. Juli 1993 (1993-07-07) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche; Beispiele 20,46,98,101,109,111-114 -----	1-7

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" Älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

17. April 2002

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

21.03.02

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Schmid, A

## Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☐ Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
2. ☐ Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. ☐ Ansprüche Nr.  
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

## Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die Internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese Internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. ☐ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser Internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser Internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. ☒ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:  
1-7

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- ☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
- ☐ Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

## WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-7

Triazolopyrimidine der Formel (I)

2. Ansprüche: 8,9

Amine der Formel IIIa sowie Verfahren zu deren Herstellung

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichung, die zu seinen Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/14415

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9846607 A	22-10-1998	AT 202779 T	15-07-2001
		AU 6576898 A	11-11-1998
		DE 69801048 D1	09-08-2001
		DE 69801048 T2	14-03-2002
		DK 975634 T3	24-09-2001
		EP 0975634 A1	02-02-2000
		ES 2160408 T3	01-11-2001
		PT 975634 T	28-12-2001
		WO 9846607 A1	22-10-1998
		ZA 9803055 A	11-10-1999
EP 0550113 A	07-07-1993	EP 0550113 A2	07-07-1993
		EP 0782997 A2	09-07-1997
		GR 3033916 T3	30-11-2000
		AT 159256 T	15-11-1997
		AT 192154 T	15-05-2000
		AU 667204 B2	14-03-1996
		AU 3043592 A	01-07-1993
		BR 9205172 A	06-07-1993
		CA 2086404 A1	01-07-1993
		CN 1075144 A ,B	11-08-1993
		CN 1141119 A ,B	29-01-1997
		DE 69222746 D1	20-11-1997
		DE 69222746 T2	12-02-1998
		DE 69230977 D1	31-05-2000
		DE 69230977 T2	09-11-2000
		DK 550113 T3	09-02-1998
		DK 782997 T3	07-08-2000
		ES 2108727 T3	01-01-1998
		ES 2147411 T3	01-09-2000
		GR 3025920 T3	30-04-1998
		HK 1010105 A1	23-06-2000
		HU 217349 B	28-01-2000
		IL 104244 A	13-07-1997
		JP 5271234 A	19-10-1993
		NZ 245581 A	26-07-1995
		PL 174047 B1	30-06-1998
		PL 171579 B1	30-05-1997
		PT 782997 T	29-09-2000
		RU 2089552 C1	10-09-1997
		SG 47563 A1	17-04-1998
		US 5593996 A	14-01-1997
		ZA 9210043 A	28-07-1993